

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 10 月 6 日 (06.10.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/092902 A1

(51) 国際特許分類: C07F 7/10 // A61K 31/519, A61P 35/00, C07B 53/00, C07D 475/04, C07M 7:00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/006416

(22) 国際出願日: 2005 年 3 月 25 日 (25.03.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-92973 2004 年 3 月 26 日 (26.03.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 独立行政法人科学技術振興機構 (JAPAN SCIENCE AND TECHNOLOGY AGENCY) [JP/JP]; 〒332-0012 埼玉県川口市本町4丁目1番8号 Saitama (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 片岡 一則 (KATAOKA, Kazunori) [JP/JP]; 〒165-0031 東京都中野区上鷺宮5-17-22 Tokyo (JP). 秋山 好嗣 (AKIYAMA, Yoshitsugu) [JP/JP]; 〒114-0014 東京都北区田端1-10-21 コーポ竹201号 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 小田島 平吉, 外(ODAJIMA, Heikichi et al.); 〒107-0052 東京都港区赤坂1丁目9番15号 日本自転車会館 小田島特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING FOLIC ACID DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 葉酸誘導体の製造方法

(57) Abstract: An efficient process for producing a folic acid derivative being suitable for formation of a conjugate of anticancer drug and folic acid. There is disclosed a process comprising the step of conducting a reaction between a 2-amino protected pteroylimidazole and a  $\gamma$ -lower alkyl glutamate to obtain a reaction product and the subsequent step of conducting a reaction between the reaction product and an amino compound having a reactive group capable of easily reacting with a functional group of drug.

(57) 要約: 抗癌剤と葉酸とのコンジュゲートを生成するのに適する葉酸誘導体の効率的な製造方法を提供する。2-アミノ保護プテロイルイミダゾールとグルタミン酸 $\gamma$ -低級アルキルとの反応工程、次いで生成物とドラッグの官能基と容易に反応しうる反応性基を有するアミノ化合物との反応工程を含んでなる方法が開示される。